

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2004 年 12 月 23 日 (23.12.2004)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2004/110986 A1(51) 国際特許分類: C07C 237/40,  
C07D 215/38, 217/22, 263/58, 265/36, 277/68, 295/14,  
417/12, A61K 31/167, 31/428, 31/4453, 31/454, 31/4709,  
31/4725, 31/496, 31/5377, 31/538, 31/55, A61P 1/04,  
11/00, 11/06, 13/10, 17/04, 25/06, 29/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/008479

(22) 国際出願日: 2004 年 6 月 10 日 (10.06.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-167865 2003 年 6 月 12 日 (12.06.2003) JP  
特願2003-405086 2003 年 12 月 3 日 (03.12.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 山之内製薬株式会社 (YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目 3 番 1 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 倉持 孝博 (KURAMOCHI, Takahiro) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 朝井 範夫 (ASAI, Norio) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 生貝 和弘 (IKEGAI, Kazuhiro) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 赤松 清二郎 (AKAMATSU, Seijiro) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 原田 博規 (HARADA, Hiromori) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 石川 典子 (ISHIKAWA, Noriko) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP).

白神 昇平 (SHIRAKAMI, Shohei) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 宮本 聡 (MIYAMOTO, Satoshi) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 渡辺 俊博 (WATANABE, Toshihiro) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 木曾 哲男 (KISO, Tetsuo) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘 2 1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 森田 拓, 外 (MORITA, Hiroshi et al.); 〒1748612 東京都板橋区蓮根三丁目 1 7 番 1 号 山之内製薬株式会社 特許部内 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: BENZAMIDE DERIVATIVE OR SALT THEREOF

(54) 発明の名称: ベンズアミド誘導体又はその塩

(57) Abstract: A compound which functions to inhibit capsaicin receptor VR1 activation and is useful as a therapeutic agent for, e.g., various pains including inflammatory pain and neurogenic pain, migraine, cluster headache, and bladder diseases including overactive bladder. It is a benzamide derivative or salt thereof, the derivative being characterized by comprising: a benzene ring; a ring D (a mono- or dicyclic hydrocarbon ring or mono- or dicyclic heteroaromatic ring) bonded to the benzene ring through an amide bond; a ring E (a mono- or dicyclic hydrocarbon ring or mono- or dicyclic heteroaromatic ring) directly bonded to the benzene ring; and A (an amino moiety or a mono- or dicyclic heteroring) bonded to the benzene ring through L (a lower alkylene).

(57) 要約: カプサイシン受容体 VR1 活性化抑制作用を有し、炎症性疼痛、神経因性疼痛を始めとする各種疼痛、片頭痛、群発頭痛、過活動膀胱を始めとする膀胱疾患等の治療剤として有用な化合物の提供。ベンゼン環がアミド結合を介して D 環 (単環若しくは 2 環系炭化水素環、又は単環若しくは 2 環系ヘテロ芳香環) と結合し、また当該ベンゼン環が直接 E 環 (単環若しくは 2 環系炭化水素環、又は単環若しくは 2 環系ヘテロ芳香環) と結合し、更に当該ベンゼン環が L (低級アルキレン) を介して A (アミノ部分、単環若しくは 2 環系ヘテロ環) と結合することを特徴とするベンズアミド誘導体又はその塩。